

T S4/7

4/7/1

DIALOG(R)File 351:Derwent WPI

(c) 2002 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

007151124

WPI Acc No: 1987-151121/198722

Oral compsn. contg. garlic powder and allinase - kept apart e.g. in separate microcapsules, but mixing after admin.

Patent Assignee: SCHERER GMBH R P (SCHB)

Inventor: HESS H; MEHN S; SCHONMANN H

Number of Countries: 016 Number of Patents: 008

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
DE 3541304	A	19870527	DE 3541304	A	19851122	198722 B
EP 224157	A	19870603	EP 86115892	A	19861115	198722
AU 8665559	A	19870528				198728
JP 62142118	A	19870625	JP 86278529	A	19861121	198731
US 4849218	A	19890718	US 86929350	A	19861112	198936
EP 224157	B	19900124				199004
DE 3668411	G	19900301				199010
ES 2012339	B	19900316				199017

Priority Applications (No Type Date): DE 3541304 A 19851122

Cited Patents: DE 2037947; DE 2639130; EP 180672; WO 8303061

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
DE 3541304	A		3		
EP 224157	A	G	4		

Designated States (Regional): AT BE CH DE ES FR GB IT LI LU NL SE

US 4849218 A 3

EP 224157 B G

Designated States (Regional): AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI LU NL S

Abstract (Basic): DE 3541304 A

Oral compsn. comprises garlic powder (I) and the enzyme allina (II) which are kept separate from each other but become combined a the compsn. has been taken.

Pref. (I) and (II) are (a) separately microencapsulated or separately formed into fat pellets, then the 2 types of microcapsules/pellets mixed; (b) formed into separate layers of a two-layer tablet or (c) suspended in a mixt. of satd. triglyceride vegetable oil and then filled into a soft gelatin capsule.

USE/ADVANTAGE - The compsn. can be prepd. easily and reproduc are storage stable and free of unpleasant garlic odour. They provi the full range of activities of garlic.

0/0

Abstract (Equivalent): EP 224157 B

Oral preparations of garlic, containing garlic powder as well

the enzyme allinase, characterised in that both of the components present spatially separated from one another, but will be recombined once taken in. (4pp)

Abstract (Equivalent): US 4849218 A

Storage stable oral garlic prepn. comprises (a) an active garlic powder; and (b) allinase; spatially sepd. from (a) so they cannot be released before oral administration.

Prepn. comprises (i) a microcapsule mixt., such that (a) and (b) are separately encapsulated; (ii) a pellet mixt., such that (b) comprises spray-modified pellets of fat base of m.p. below 40 deg and (a) comprises spray-modified pellets; (iii) a 2-layer tablet c (a) and (b) in separate layers; or (iv) a soft gelatine capsules c a mixt. of satd. triglycerides and vegetable oil in which (a) and (b) are suspended.

ADVANTAGE - Does not cause annoying bad odour, and exhibits full activity of garlic when administered. (3pp)r

Derwent Class: D13

International Patent Class (Additional): A01N-063/02; A23L-001/22; A61K-009/52; A61K-035/78; A61K-037/56

?

①9 BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

①2 Off nl gungsschrift
①1 DE 3541304 A1

①7 Int. Cl. 4:
A23L 1/221

②1 Aktenzeichen: P 35 41 304.2
②2 Anmeldetag: 22. 11. 85
④3 Offenlegungstag: 27. 5. 87

Behördeneigentum

DE 3541304 A1

⑦1 Anmelder:

R.P. Scherer GmbH, 6930 Eberbach, DE

⑦4 Vertreter:

Schönwald, K., Dr.-Ing.; von Kreisler, A.,
Dipl.-Chem.; Fues, J., Dipl.-Chem. Dr.rer.nat.; Keller,
J., Dipl.-Chem.; Sektig, G., Dipl.-Ing.; Werner, H.,
Dipl.-Chem. Dr.rer.nat., Pat.-Anw., 5000 Köln

⑦2 Erfinder:

Hess, Heinz, 6932 Hirschhorn, DE; Mehn, Siegfried;
Schönmann, Holger, Dipl.-Chem. Dr., 6930 Eberbach, -
DE

⑤4 Orale Zubereitungen von Knoblauch und Verfahren zu ihrer Herstellung

Orale Zubereitungen von Knoblauch enthalten sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase, wobei jedoch die beiden Komponenten räumlich voneinander getrennt vorliegen und erst nach der Einnahme wiedervereint werden.

DE 3541304 A1

1. Orale Zubereitungen von Knoblauch enthaltend sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase, dadurch gekennzeichnet, daß die beiden Komponenten räumlich voneinander getrennt vorliegen, jedoch nach der Einnahme wiedervereinigt werden.

2. Zubereitungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß jede der beiden Komponenten für sich mikroverkapselt vorliegt und beide Arten von Mikrokapseln miteinander vermischt vorliegen.

3. Zubereitungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß das Enzym in Form sprüherstarrer Pellets, deren Fettgrundlage einen Schmelzpunkt unter 40°C aufweist, und das Knoblauchpulver in Form sprüherstarrer Fettpellets vorliegt und beide Arten von Pellets miteinander vermischt vorliegen.

4. Zubereitungen gemäß Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß das Gemisch in Hartgelatine-kapseln abgefüllt ist.

5. Zubereitungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß das Knoblauchpulver und das Enzym in je einer Schicht einer Zweischichttablette vorliegen.

6. Zubereitungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die beiden Komponenten in einer Mischung von gesättigten Triglyceriden und Pflanzenöl suspendiert vorliegen und in Weichgelatine-kapseln abgefüllt sind.

7. Verfahren zur Herstellung von oralen Zubereitungen von Knoblauch enthaltend sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase, dadurch gekennzeichnet, daß jede der beiden Komponenten für sich mikroverkapselt wird und beide Arten von Mikrokapseln miteinander vermischt werden.

8. Verfahren zur Herstellung von oralen Zubereitungen von Knoblauch enthaltend sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase, dadurch gekennzeichnet, daß

a) das Enzym in einem geschmolzenen Hartfett bei Temperaturen bis 40°C dispergiert, und durch Sprüherstarrung pelletisiert wird,

b) das Knoblauchpulver in geschmolzener Fettgrundlage dispergiert und durch Sprüherstarrung pelletisiert wird,

c) beide Arten von Pellets gegebenenfalls unter Zumischung von Maisstärke miteinander vermischt und in Hartgelatine-kapseln abgefüllt werden.

9. Verfahren zur Herstellung von oralen Zubereitungen von Knoblauch enthaltend sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase, dadurch gekennzeichnet, daß sowohl das Knoblauchpulver als auch das Enzym in tablettierbare Form gebracht und in einer Zweischichttablettendruckmaschine zu Zweischichttabletten verarbeitet werden.

10. Verfahren zur Herstellung von oralen Zubereitungen von Knoblauch enthaltend sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase, dadurch gekennzeichnet, daß beide Komponenten in einer Mischung von gesättigten Triglyceriden und Pflanzenöl suspendiert und in in an sich bekannter Weise in Weichgelatine-kapseln abgefüllt werden.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind orale Zubereitungen von Knoblauch enthaltend sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase.

Die bisher bekannten oralen Zubereitungen von Knoblauch enthalten entweder nur Knoblauchpulver und haben sich als nahezu wirkungslos erwiesen, oder enthalten sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase. Knoblauchpulver ist entweder eine gemahlene Droge oder ein getrockneter Drogenauszug, in denen das natürlicherweise vorkommende Enzym Allinase zerstört wurde. Die Zerstörung erfolgt üblicherweise durch kurzzeitige Erhitzung auf Temperaturen über 70°C, bei denen die übrigen Bestandteile des Knoblauchpulvers praktisch unverändert bleiben. Weiterhin sind chemische Methoden zur Zerstörung des Enzyms Allinase bekannt.

Zubereitungen, die sowohl Knoblauchpulver als auch das Enzym Allinase enthalten, sind instabil und besitzen den bekannten unangenehmen Geruch des Knoblauchs. Weitere bekannte Zubereitungen enthalten nur noch schwankende Restmengen des Enzyms Allinase und schwanken daher bezüglich Stabilität, Wirksamkeit und Geruchsbelästigung. Es war somit zumindest bisher nicht möglich, in reproduzierbarer Weise orale Knoblauchzubereitungen herzustellen, die allen Anforderungen an ein derartiges Präparat gerecht werden.

Die Erfindung hat sich die Aufgabe gestellt, orale Zubereitungen von Knoblauch zu entwickeln, welche sowohl das Knoblauchpulver in wirksamer Form als auch das Enzym Allinase enthalten, reproduzierbar und leicht herstellbar sind, lagerfähig sind, keine Geruchsbelästigung zeigen und dennoch nach der Einnahme die volle Wirksamkeit des Knoblauchs aufweisen.

Diese Aufgabe kann erfindungsgemäß dadurch gelöst werden, daß die beiden Komponenten räumlich voneinander getrennt vorliegen, jedoch nach der Einnahme wiedervereinigt werden.

Diese Aufgabe kann beispielsweise gelöst werden, dadurch daß jede der beiden Komponenten für sich mikroverkapselt und beide Arten von Mikrokapseln miteinander vermischt vorliegen. Weiterhin ist es möglich, das Enzym in Form sprüherstarrer Pellets, deren Fettgrundlage einen Schmelzpunkt unter 40°C aufweist, und das Knoblauchpulver in Form von sprüherstarrten Fettpellets zu bringen und beide Arten von Pellets miteinander zu vermischen. Bei der Vermischung dieser beiden Arten von Pellets kann es zweckmäßig sein, geringe Mengen von Maisstärke zuzumischen, die die Klebrigkeit der Pellets herabsetzt. Dieses Gemisch kann dann in an sich bekannter Weise in Hartgelatine-kapseln abgefüllt werden.

Eine weitere Lösungsmöglichkeit besteht darin, das Knoblauchpulver und das Enzym in tablettierbare Form zu bringen und jedes dieser beiden Vormischungen in an sich bekannter Weise in eine Schicht einer Zweischichttablette zu verpressen.

Schließlich ist es möglich, die beiden Komponenten in einer Mischung von gesättigten Triglyceriden und Pflanzenöl zu suspendieren und in dieser Form in an sich bekannter Weise in Weichgelatine-kapseln abzufüllen.

Alle diese Zubereitungsformen haben sich als stabil erwiesen, gestatten jedoch den beiden Komponenten nach der Einnahme miteinander zu reagieren und die wirksamen Bestandteile des natürlichen Knoblauchs zu entwickeln.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind somit

die oben beschriebenen oralen Zubereitungsformen sowie die Verfahren zu ihrer Herstellung gemäß obiger Patentansprüche.

Weitere Einzelheiten, typische Ausführungsformen der oralen Zubereitungen und der Verfahren zu ihrer Herstellung sind in den nachfolgenden Beispielen näher erläutert.

Beispiel 1

Fettpellets in Hartkapseln

20 kg Knoblauchpulver werden in 80 kg geschmolzenem Glycerinmonostearat feinst dispergiert. Die heiße Suspension wird durch eine rotierende Düse mit 0,5 mm Bohrung durch Sprüherstarrung pelletisiert. 5 kg Allinase (Pulver) werden in 20 kg geschmolzenem Hartfett, dessen Temperatur 40°C nicht übersteigen darf, ebenfalls durch Sprüherstarrung pelletisiert. Nach dem Absieben der geeigneten Kornfraktionen werden beide Pelletarten in einen Konusmischer zusammen mit 0,25% Maisstärke gemischt. Von der fertigen Pelletmischung werden 501,25 mg pro Hartkapsel abgefüllt.

Beispiel 2

Zweischicht-Filmtablette

20 kg Knoblauchpulver werden in einer Schmelze aus 35,8 kg Cetylalkohol und 1,7 kg Lecithin suspendiert. Die erkaltete Suspension wird in geeigneter Weise grob pulverisiert. Dem Pulver werden 1,5 kg Maisstärke und 1 kg pyrogene Kieselsäure (Aerosil 200®) zugesetzt (Pulver 1).

Aus 5 kg Allinase (Pulver) 13 kg gehärtetes Rizinusöl, 5 kg Maisstärke, 1 kg Stearinsäure und 1 kg Methylcellulose wird durch Trockenmischen ein Granulat hergestellt (Pulver 2).

Auf einer Zweischichttablettendruckpresse werden aus 240 mg Pulver 1 und 100 mg Pulver 2 Tablettenkerne hergestellt. Die Kerne werden mit einem feuchtigkeitsabweisenden Schellackfilm vorlackiert und danach mit einer Suspension aus Pharmacoat 606®, Titandioxid, PEG 6000 mit Eisenoxidgelb in Wasser gecoatet.

Beispiel 3

Weichgelatine-kapseln

20 kg Allinase (Pulver) und 80 kg Knoblauchpulver werden in einer Mischung aus 54 kg gesättigten Triglyceriden und 146 kg Pflanzenöl suspendiert. Die Suspension wird in geeigneter Weise homogenisiert, gesiebt und entlüftet. Jeweils 300 mg der Suspension werden in bekannter Weise in Weichgelatine-kapseln abgefüllt.

- Leerseite -